VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM **GEBIET DES PATENTWESENS**

PCT INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT PATENTIERBARKEIT PCT | DEF | DIFE | 2006

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Geber Patentwesenspor

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts M/44344-PCT			WEITERES VORG	EHEN	siehe Formblatt PCT/IPEA/416		
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014621			Internationales Anmelde 22.12.2004	edatum <i>(TagMonat/Jahr)</i>	Prioritätsdatum (TagMonatUahr) 23.12.2003		
Internation	nale Patentklas	sifikation (IPK) oder	nationale Klassifikation u	nd IPK			
C07D21	13/81, A01N4	13/40					
Anmelder	 						
1		ELLSCHAFT et	al.				
inte	 Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 						
2. Die	eser BERICHT	umfaßt insgesan	nt 5 Blätter einschließl	ich dieses Deckblatts.			
3. Au	Berdem lieger	n dem Bericht ANI	LAGEN bei; diese umfa	assen			
a. l	🛛 (an den A	Anmelder und das	Internationale Büro ge	sandt) insgesamt 4 Blät	ter; dabei handelt es sich um		
	⊠ Blätte	er mit der Beschre	eibung, Ansprüchen und	d/oder Zeichnungen, die	geändert wurden und diesem Bericht		
	zugru 70 16	ınde liegen, und/o Sund Abschnitt 60	der Blätter mit Berichtig 77 der Verwaltungsvors	gungen, denen die Behö schriften)	rde zugestimmt hat (siehe Regel		
				•	unkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen		
	Grün	den nach Auffass	ung der Behörde eine <i>i</i>	Änderung enthalten, die n eingereichten Fassung	über den Offenbarungsgehalt der		
b. 1	🗌 (nur an da	as Internationale l	B <i>üro gesandt)</i> i> insges	amt (bitte Art und Anzah	ıl der/des elektronischen		
	nur in cor	ger(s) angeben), mputerlesbarer Fo 'erwaltungsvorsch	rm, wie im Zusatzfeld I	otokoll und/oder die dazu betreffend das Sequenzp	igehörigen Tabellen enthält/enthalten, protokoll angegeben (siehe Abschnitt		
4. Die	eser Bericht er	nthält Angaben zu	folgenden Punkten:				
	Feld Nr. I	Grundlage des E	Bescheids				
	Feld Nr. II	Priorität					
	Feld Nr. III	Keine Erstellung Anwendbarkeit	eines Gutachtens übe	r Neuheit, erfinderische	Tätigkeit und gewerbliche		
	Feld Nr. IV	Mangelnde Einh	eitlichkeit der Erfindun	g			
	Feld Nr. V	Begründete Fes und der gewerbi	tstellung nach Arikel 35 ichen Anwendbarkeit; l	i(2) hinsichtlich der Neul Jnterlagen und Erklärun	neit, der erfinderischen Tätigkeit gen zur Stützung dieser Feststellung		
	Feld Nr. VI	Bestimmte ange	führte Unterlagen				
	Feld Nr. VII	Bestimmte Mäng	gel der internationalen .	Anmeldung			
	Feld Nr. VIII	Bestimmte Bem	erkungen zur internatio	nalen Anmeldung			
Datum der Einreichung des Antrags				Datum der Fertigstellung	dieses Berichts		
1							
20.10.2005				31.01.2006			
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung			onalen Prüfung	Bevollmächtigter Bediens	eteter .nes Poten-		
beauftragten Behörde Europäisches Patentamt					Jugarthan M. E.		
D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d			56 enmu d	Stroeter, T	Coverie .		
Fax: +49 89 2399 - 4465			o opina a	Tel. +49 89 2399-8088	Sourge on the same		

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014621

-	Feld Nr. I Grundlage		
-		es Berichts	
1	•	beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.	
	☐ internationale Re☐ Veröffentlichung	if einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, e Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist herche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b)) er internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4) äufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)	t:
2	P. Hinsichtlich der Bestand Anmeldeamt auf eine Au	e ile * der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf <i>(Ersatzblätter, die dem forderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts aund sind ihm nicht beigefügt):</i>	als
	Beschreibung, Seiten		
	1-37	in der ursprünglich eingereichten Fassung	
	Ansprüche, Nr.		
	1-13	eingegangen am 29.11.2005 mit Schreiben vom 28.11.2005	
	☐ einem Sequenzproto Sequenzprotokoll	oll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das	
3.	☐ Beschreibung: Sei	gen sind folgende Unterlagen fortgefallen:	
	☐ Ansprüche: Nr.☐ Zeichnungen: Blat☐ Sequenzprotokoll☐ etwaige zum Segu	Abb. genaue Angaben): nzprotokoll gehörende Tabellen <i>(genaue Angaben)</i> :	
	Auffassung der Behörde ü (Regel 70.2 c)).	Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigefügten und nachstehend rstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach er den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen	1
	☐ Beschreibung: Seit☐ Ansprüche: Nr.☐ Zeichnungen: Blatt☐ Sequenzprotokoll (☐ etwaige zum Seque	Abb.	
	* Wenn Punkt 4 zutr "ersetzt" versehen w	fft können einige eden 33 34	J

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/014621

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 1-13

Nein: Ansprüche

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Ja: Ansprüche 1-13

Nein: Ansprüche

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Ja: Ansprüche: 1-13

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- Die vorliegende Anmeldung betrifft 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide welche als Fungizide in der Bekämpfung von Schadpilzen einsetzbar sind. Beansprucht werden solche Verbindungen (unabhängiger Anspruch 1) und ihre Verwendung (unabhängiger Anspruch 11) sowie fungizide Mittel (unabhängiger Anspruch 12) und Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen (unabhängiger Anspruch 13).
- 2 Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:
 - D1: WO 02/096882 A1 (NIHON NOHYAKU CO., LTD) 5. Dezember 2002
 - D2: PATENT ABSTRACTS OF JAPAN Bd. 007, Nr. 195 (C-183), 25. August 1983 & JP 58 096069 A (ISHIHARA SANGYO KK), 7. Juni 1983
 - D3: EP-A-0 545 099 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 9. Juni 1993
 - D4: WO 03/074491 A (SYNGENTA PARTICIPATONS AG; EHRENFREUND, JOSEF; TOBLER, HANS; WALTER,) 12. September 2003
- Die vorliegenden geänderten Ansprüche sind nun neu im Sinne des Artikels 33(2) PCT gegenüber den vormals überlappenden Ansprüchen 1-3 bzw. 5-7 aus D1, da die Verbindung 3-1 bzw. wie auch alle Verbindungen der genannten Ansprüche aus D1 nicht mehr in den von der vorliegenden Anmeldung beanspruchten Bereich fallen: In D1 sind nur strukturell verwandte Verbindungen offenbart, welche zwei statt einem Substituenten (vorl. Anm.: nur X-R⁵) zusätzlich zur Amidgruppe am Phenylring tragen.
- Durch Einreichung von Vergleichsdaten machte der Anmelder glaubhaft, das Problem verbesserte fungizide 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide im Hinblick auf die strukturell naheliegendsten Fungizide aus D1 bzw. D3 erfolgreich gelöst zu haben. Ein solche verbesserte Wirkung ist im Lichte des relevanten Standes der Technik nicht nahegelegt und daher erscheinen die vorliegenden Ansprüche erfinderisch im Sinne des Art. 33(3) PCT zu sein.

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ZUR PATENTIERBARKEIT (BEIBLATT)

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014621

Die vorliegenden Ansprüche sind gewerblich anwendbar und erfüllen die Erfordernisse des Art. 33(4) PCT.

15

30

42

Patentansprüche

1. 3-Trifluormethylpicolinsäureanilide der allgemeinen Formel I.

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & W \\
N & 1 \\
R^2 & CF_3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
K^2 & K^3 & K^4
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
K^3 & K^4 & K^5
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
K^3 & K^4 & K^5
\end{array}$$

worin die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

10 Х O, S oder direkte Bindung;

> W O oder S:

R¹, R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

R⁴ Wasserstoff, OH, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 3 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;

 R^5 unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-20 Cycloalkenyl, C₃-C₁₂-Alkinyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, wobei die 5 letztgenannten Gruppen jeweils 1, 2 oder 3 Substituenten R9 aufweisen können, und wobei die Wasserstoffatome in den 5 letztgenannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können; C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₁₂-Alkyl, das 1, 2 oder 3 Substituenten R¹¹ auf-25

weist. eine Gruppe -C(R¹⁰)=NOR⁸, eine Gruppe -C(O)NR¹³R¹⁴; Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, Phenyl-C₂-C₆-alkenyl, Phenyl-C₂-C₆-alkinyl, Phenyloxy-C₁-C₆-alkyl, Phenyloxy-C₂-C₆-alkenyl, Phenyloxy-C₂-C₆-alkinyl, wobei der Alkyl-, Alkenyl- und der Alkinyl-Teil in den 6 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Substituenten R¹¹ aufweisen kann und der Phenylring in den 7 zuletzt genannten Gruppen 1, 2, 3 oder 4 Reste R⁷ tragen

kann:

 R^6 die für R¹ genannten, von Wasserstoff verschiedenen Bedeutungen;

 R^7 C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆- Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-

35 Alkenyloxy, C2-C4-Alkinyl, C2-C4-Alkinyloxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen 7 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein

5		können, OH, Halogen, Nitro, CN, C ₁ -C ₄ -Alkylthio, C ₁ -C ₄ -Alkylsulfonyl, – C(O)R ¹² , NR ¹³ R ¹⁴ , -C(O)NR ¹³ R ¹⁴ , -C(S)NR ¹³ R ¹⁴ , -C(R ¹⁰)=NOR ⁸ , Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R ⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, Phenoxy, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R ⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, C ₁ -C ₆ -Alkyl-Phenyl, wobei die Wasserstoffatome des Alkylteils teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und der Phenylring 1, 2, 3 oder 4 der unter R ⁶ genannten Gruppen aufweisen kann, wobei zwei an benachbarte Kohlenstoffatome gebundene Reste R ⁷ auch für CH=CH-CH=CH oder eine Alkylenkette mit 3 bis 5 Gliedern stehen können, worin 1 oder 2 nicht benachbarte CH ₂ -Gruppen auch durch Sauerstoff oder
		Schwefel ersetzt sein können und worin ein Teil oder alle Wasserstoffe
		durch Halogen ersetzt sein können;
	R ⁸	C ₁ -C ₄ -Alkyl, C ₃ -C ₆ -Cycloalkyl, C ₂ -C ₄ -Alkenyl, C ₂ -C ₄ -Alkinyl, wobei die Was-
15		serstoffatome in diesen 4 Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können,
į		Phenyl oder Phenyl-C₁-C₀-alkyl, wobei Phenyl in den zwei letztgenannten
		Resten 1, 2, 3 oder 4 der unter R ⁶ genannten Gruppen aufweisen kann;
	R^9	C ₁ -C ₄ -Alkyl, C ₁ -C ₈ -Alkoxy, C ₂ -C ₈ -Alkenyloxy, C ₂ -C ₈ -Alkinyloxy, C ₁ -C ₄ -
		Alkoxy-C ₁ -C ₈ -alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teil-
20		weise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
	R ¹⁰	Wasserstoff, Halogen, C ₁ -C ₈ -Alkoxy, C ₂ -C ₈ -Alkenyloxy, C ₂ -C ₈ -Alkinyloxy,
		C ₁ -C ₄ -Alkoxy-C ₁ -C ₈ -alkoxy, C ₁ -C ₁₂ -Alkyl, C ₃ -C ₁₂ -Cycloalkyl, C ₂ -C ₁₂ -Alkenyl,
		C ₅ -C ₁₂ -Cycloalkenyl, C ₃ -C ₁₂ -Cycloalkyl-C ₁ -C ₄ -alkyl, wobei die Wasserstoff-
25		atome in den 9 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können;
		Phenyl, das 1, 2, 3 oder 4 der unter R ⁷ genannten Gruppen aufweisen
		kann,
	R ¹¹	C ₁ -C ₄ -Alkyl, C ₁ -C ₈ -Alkoxy, C ₁ -C ₈ -Alkoxy-C ₁ -C ₈ -alkoxy, C ₂ -C ₈ -Alkenyloxy,
		C ₂ -C ₈ -Alkinyloxy, C ₁ -C ₄ -Alkoxy-C ₁ -C ₈ -alkoxy, wobei die Wasserstoffatome
30		in diesen Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein
	40	können, oder Halogen;
	R ¹²	Wasserstoff, OH, C ₁ -C ₄ -Alkyl, C ₁ -C ₄ -Alkoxy, C ₂ -C ₄ -Alkenyl, C ₂ -C ₄ -Alkinyl,
		C ₂ -C ₄ -Alkenyloxy, C ₂ -C ₄ -Alkinyloxy, C ₁ -C ₄ -Alkoxy-C ₁ -C ₄ -alkoxy, wobei die Wasserstoffatome in den 7 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder voll-
35		ständig durch Halogen substituiert sein können;
	R ¹³ , R ¹⁴	unabhängig voneinander Wasserstoff, C ₁ -C ₄ -Alkyl, C ₂ -C ₄ -Alkenyl, C ₂ -C ₄ -
	·	Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in diesen Gruppen teilweise oder voll-
		ständig durch Halogen substituiert sein können;

40 und die landwirtschaftlich brauchbaren Salze von I.

20

25

35

44

- 2. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin R¹, R² und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl bedeuten.
- 5 3. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, worin R¹, R² und R³ jeweils für Wasserstoff stehen.
 - 4. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R⁴ ausgewählt ist unter Wasserstoff, Methyl, OH oder Methoxy.
 - 5. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 4, worin R⁴ für Wasserstoff steht.
- 6. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R⁵ eine der folgenden Bedeutungen aufweist:
 - unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können,
 - C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl;
 - Phenyl, Phenyl-C₁-C₀-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3 oder 4 Resten R⁷ substituiert sein kann; oder
 - C(C₁-C₄-Alkyl)=NO-R⁸, wobei die Wasserstoffatome der C₁-C₄-Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.
- 7. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen R⁶ die folgenden Bedeutungen aufweist C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, wobei diese Gruppen durch Halogen substituiert sein können, oder Halogen.
 - 8. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, worin R¹, R² und R³ jeweils für Wasserstoff stehen und die Gruppe X-R⁵ in orthooder meta-Position zum Amidstickstoff gebunden ist.
 - 9. Anilide der allgemeinen Formel I nach einem der vorhergehenden Ansprüche, in denen X eine direkte Bindung oder Sauerstoff bedeutet.

20

45

- 10. Anilide der allgemeinen Formel I nach Anspruch 9, in denen die Gruppe X für Sauerstoff oder eine direkte Bindung steht und R⁵ eine der folgenden Bedeutungen aufweist:
- unsubstituiertes C₄-C₁₂-Alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, C₅-C₁₂-Cycloalkenyl, C₂-C₁₂-Alkinyl, wobei die Wasserstoffatome in den 4 zuletzt genannten Gruppen teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können und die Wasserstoffatome in C₃-C₁₂-Cycloalkyl teilweise oder vollständig durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein können;
- C₁-C₁₂-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl;
 - Phenyl, Phenyl-C₁-C₆-alkyl, wobei der Phenylring mit 1, 2, 3 oder 4 Resten R⁷ substituiert sein kann; oder
 - C(C₁-C₄-Alkyl)=NO-R⁸, wobei die Wasserstoffatome der C₁-C₄-Alkylgruppe teilweise oder vollständig durch Halogen substituiert sein können.
 - 11. Verwendung von 3-Trifluormethylpicolinsäureaniliden der allgemeinen Formel I und ihren landwirtschaftlich verträglichen Salzen gemäß einem der vorhergehenden Ansprüche zur Bekämpfung von Schadpilzen.
 - 12. Fungizide Mittel, enthaltend eine fungizid wirksame Menge mindestens eines 3-Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10.
- Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Schadpilze, deren Lebensraum oder die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Flächen, Materialien oder Räume mit mindestens einer fungizid wirksamen Menge eines 3-Trifluormethylpicolinsäureanilids der allgemeinen Formel I oder eines landwirtschaftlich verträglichen Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 10 behandelt.